## 世界知的所有権機關 国際事務局



## 特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類6

A61K 31/40, 31/415, 31/42, 31/425, 31/445, 31/495, 31/535, 35/05, 35/06, 35/55, C07D 207/16, 405/12, 413/12,

(11) 国際公開番号 A1

WO98/01133

417/12, C07K 5/078, 5/083

(43) 国際公開日

1998年1月15日(15.01.98)

(21) 国際出願番号

(22) 国際出願日

1997年7月8日(08.07.97)

(30) 優先権データ 特願平8/177955

1996年7月8日(08.07.96)

(71) 出願人(米国を除くすべての指定国について) 山之内製薬株式会社

(YAMANOUCHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.)[JP/JP] 〒103 東京都中央区日本橋本町2丁月3番11号 Tokyo, (JP)

(72) 発明者;および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ)

相部和彦(AIBF, Kazuhiko)[JP/JP]

〒270-01 千葉県流山市富士見台二丁目14番8-202 Chiba, (JP)

竹林幸弘(TAKEBAYASHI, Yukihiro)[JP/JP]

〒305 茨城県つくば市二の宮二丁目5番9-312 Ibaraki, (JP) 石井康高(ISIIII, Yasutaka)[JP/JP]

〒305 茨城県つくば市松代三丁目6番13-301 Ibaraki, (JP) 野城 修(NOSHIRO, Osamu)[JP/JP]

〒301 茨城県竜ヶ崎市長山六丁目15番9号 Ibaraki, (JP)

野田一生(NODA, Ichio)[JP/JP]

〒305 茨城県つくば市春日二丁目35番2-304 Ibaraki, (JP)

PCT/JP97/02357 五十嵐進(IGARASHI, Susumu)[JP/JP]

〒305 茨城県つくば市小野川4-19 Ibaraki, (JP)

(74) 代理人

弁理士 長井省三,外(NAGAI, Shozo et al.) 〒174 東京都板橋区小豆沢1丁目1番8号

山之内製薬株式会社 特許情報部内 Tokyo, (JP)

AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CU, CZ, EE, GE, GH, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SD, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ARIPO特許 (GH, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), ユーラシア特 許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), 欧州特許 (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類

国際調査報告書

(54) Title: **BONE RESORPTION INHIBITORS** 

(54)発明の名称 骨吸収阻害剤

## (57) Abstract

Drugs, in particular, bone resorption inhibitors containing as the active ingredient compounds having selective cathepsin K inhibitory effects, among all, proline derivatives represented by general formula (I) or pharmaceutically acceptable salts thereof. wherein each symbol has the meaning as specified below: X: a moiety (except for the C-terminal carbonyl group) of an amino acid residue with its side chain optionally protected; R1: an amino-protective group; G: a glycine residue; n: 0 or 1; R3: a group inhibiting the activity of the SH group of cysteine protease; and R4: hydrogen, hydroxy or phenyl.

$$R^{1}-(G)n-N-X-R^{3}$$